

BASF Aktiengesellschaft



BASF Aktiengesellschaft · 67056 Ludwigshafen

Europäisches Patentamt  
Erhardtstraße 27

D-80298 München

14-01-1995	
10	ANL. ZEICHN.

H2-6

11.01.95  
Patentabteilung-C6  
ZDX/P - Dr. Wolf  
42835.ep4  
Tel. 0621/60-20667  
Telex 17 62 157 170  
Ttx 62 157 170=BASF  
Tfx 0621/60 21183

*Response to  
Second Office  
Action*

EP-Anmeldung Nr.: 92 119 105.2-1211 - O.Z. 0050/42835  
Bescheid vom: 05.09.94

Wir bitten, dem weiteren Verfahren den beiliegenden Anspruchssatz zugrunde zu legen (Anlage 1).

Damit die Änderungen gegenüber dem mit Schreiben vom 27.05.94 vorgelegten Anspruchssatz besser erkennbar sind, haben wir ferner unsere handschriftlich überarbeitete Korrekturvorlage beigelegt (Anlage 2).

Wird dieser Anspruchssatz für gewährbar erachtet, würden wir die Beschreibung hieran anpassen sowie sämtliche geänderten Seiten dreifach in Reinschrift vorlegen.

#### Gegenstand der Ansprüche

Die beigelegten Ansprüche haben folgende recherchierte Gruppen von Verbindungen zum Gegenstand, wobei die Numerierung der Gruppen jener des Recherchenberichts vom 04.10.93 entspricht:

Gruppe 1: Pyridin-3-yl-Derivate

Gruppe 7: Thiazol-4-yl-Derivate, Thiazol-5-yl-Derivate, Oxazol-5-yl-Derivate

Gruppe 8: Pyrazol-4-yl-Derivate.

Aus Gründen der Übersichtlichkeit wurde Anspruch 6 vor Anspruch 2 und Anspruch 11 vor Anspruch 7 eingefügt. Die Ansprüche 3 und 8, welche Gegenstände betreffen, die nicht in die vorgenannten Gruppen 1, 7 und 8 fallen, wurden gestrichen. Des weiteren wurden die Ansprüche 4 und 5 sowie 9 und 10 (ursprüngliche Numerierung) zusammengefaßt. Der neue Anspruchssatz besteht daher aus 7 Ansprüchen.

M. Padmos  
tel: 2044

23. 1. 1995

\* ex. 3

Telefon (0621) 60-0 (Vermittlung)  
Telefax (0621) 60-42525 (Zentrale)  
Telex 46499-0 bas d (Vermittlung)  
Teletex 62157 = BASF (Vermittlung)  
Telegramme: BASF Ludwigshafenrhein

Bankverbindung:  
Landeszentralbank 67008 Ludwigshafen,  
Girokonto 54507300 (BLZ 54500000)  
Sitz der Gesellschaft:  
67056 Ludwigshafen, Deutschland  
Registergericht: Amtsgericht Ludwigshafen,  
Eintragungsnummer: HRB 3000

Aufsichtsratsvorsitzender: Hans Albers  
Vorstand: Jürgen Strube, Vorsitzender;  
Wolfgang Jentzsch, stellv. Vorsitzender;  
Albrecht Eckell; Max Dietrich Kley;  
Hans-Jürgen Quadbeck-Seeger;  
Hanns-Helge Stechl; Dieter Stein;  
Dietmar Werner; Gerhard Wolf

N 13.01.95

Po

EP Anmeldung Nr. 92 119 105.2-1211 - O.Z. 0050/42835

- 2 -

Die neuen Ansprüche 2 bis 4 wurden als abhängige Ansprüche zu Anspruch 1 formuliert (vgl. Punkt 11 des Bescheids).

Als Stand der Technik sind für die vorliegenden Ansprüche die Dokumente D8 und D13 bis D19 gemäß Punkt 1 des obengenannten Bescheids zu diskutieren. Dokument D19 gilt, wie dort unter Punkt 8 ausgeführt, als Stand der Technik gemäß Artikel 54(3) und (4) EPÜ.

Wir behalten uns vor, die nicht mehr von den Ansprüchen umfaßten Gegenstände in einer Teilanmeldung weiterzuverfolgen. Zu den auf diese Gegenstände bezogenen Einwände der Prüfungsabteilung gemäß den Punkten 5 bis 7 (vollständig) sowie 9 und 10 (teilweise) des Bescheids werden wir dann gegebenenfalls eingehen.

In den Ansprüchen wurde eine Reihe von Änderungen nicht-materieller Natur vorgenommen. Sie sind der Korrekturvorgabe zu entnehmen. Insbesondere wurde in der Formel I die Bezeichnung der Reste A und ihrer Substituenten (R, R<sup>1</sup> usw.) überarbeitet.

#### Diskussion der Ansprüche vor dem Stand der Technik

Aus Gründen der Übersichtlichkeit wurde für die folgende Diskussion des Standes der Technik die Gliederung in die oben genannten drei Gruppen 1, 7 und 8 beibehalten.

#### Gruppe 1 (Pyridin-3-yl-Derivate; Dokument D13)

##### Neuheit

Zur neuheitlichen Abgrenzung gegen das Dokument D13 (DE-A 24 17 216) wurden an die Ansprüche 1, 3, 4 und 7 (neue Bezeichnung) Disclaimer angefügt, und der Disclaimer in Anspruch 6 wurde überarbeitet. Insbesondere ist die Verwendung der Verbindung 2-Chlornicotinsäure-2'-iso-propylanilid zur Bekämpfung von Botrytis neu.

##### Erfinderische Tätigkeit

Der Fachmann erhält aus D13 keinen Hinweis auf die außerordentliche Wirkung der beanspruchten Verbindungen, welche in der 2-Position des über die Amidgruppe gebundenen Phenylrings substituiert sind, gegen Botrytis. Insbesondere gilt dies für das

11.13.01.95 8/

EP Anmeldung Nr. 92 119 105.2-1211 - O.Z. 0050/42835

- 3 -

bereits aus D13 allgemein als fungizid wirksam bekannte 2-Chlornicotinsäure-2'-iso-propylanilid.

Die Ergebnisse von Versuchen zur Wirksamkeit der beanspruchten Verbindungen gegen diesen Pilz gemäß Anwendungsbeispiel 1 der Anmeldung wurden nochmals in einer Tabelle dem Ergebnis mit der Verbindung 2-Chlornicotinsäure-2'-ethylanilid gegenübergestellt (vgl. Anlage 3). Die Tabelle enthält auch das Testergebnis mit 2-Chlornicotinsäure-2'-iso-propylanilid. Es wird anhand der Versuchsergebnisse deutlich, daß die beanspruchten Verbindungen unerwartet deutlich besser gegen Botrytis wirksam sind, als der Fachmann in Kenntnis des Standes der Technik (D13) erwarten konnte.

Aufgrund dieser Überlegungen sind wir der Auffassung, daß den beanspruchten Pyridin-3-yl-Derivaten samt ihrer Verwendung eine erfinderische Tätigkeit zukommt.

Gruppe 7 (Thiazol-4-yl-Derivate, Thiazol-5-yl-Derivate, Oxazol-5-yl-Derivate; Dokumente D8, D14-D17)

Neuheit und erfinderische Tätigkeit

Dokument D14 (DE-A 19 14 954): Dieses Dokument offenbart explizit die Verbindung 4-Methyl-1,3-oxazol-5-carboxanilid (vgl. Tabelle I, Seite 17, 1. Verbindung), d.h. der Anilid-Phenylring ist unsubstituiert, wohingegen die beanspruchten Verbindungen im Anilid-Phenylring einen Substituenten in ortho-Position tragen.

Die Lehre der vorliegenden Anmeldung ist gegenüber D14 als erfinderisch anzusehen, weil der Fachmann, weder was die Struktur der genannten Verbindung noch deren Wirkung gegen Botrytis angeht, in irgendeiner Weise aus D14 einen Hinweis entnehmen konnte, der zur vorliegenden Erfindung führte.

Dokument D17 (EP-A 371 950): In Anspruch 1 wurde zur neuheitlichen Abgrenzung gegen dieses Dokument für A = A2 ein Disclaimer eingeführt.

Die in D17 explizit offenbarten Verbindungen tragen im Anilid-

11.13.01.95 02

EP Anmeldung Nr. 92 119 105.2-1211 - O.Z. 0050/42835

- 4 -

Phenylring durchweg 3 bis 5 elektronenziehende Gruppen, typischerweise Halogenatome, so daß der Fachmann durch dieses Dokument nicht veranlaßt werden konnte, die vorliegenden Erfindung zu machen.

Dokument D8 (EP-A 279 239) beschreibt Anilide der 2-Chlor-1,3-thiazol-5-carbonsäure: Bei der Verbindung 3.077 in Tabelle 3 auf Seite 19 von D8 handelt es sich um ein Anilid, welches im Anilin-Phenylring ein Chlor (in nicht genannter Position) trägt. In den beanspruchten Verbindungen trägt der Anilid-Phenylring dagegen kein Chlor. Die Verbindungen 3.084 und 3.086 der Tabelle 3 in D8 tragen im Gegensatz zu den beanspruchten Verbindungen 2 bzw. 3 Substituenten im Anilid-Phenylring. Die übrigen 6 im biologischen Beispiel 3.5 genannten Verbindungen gehören zu dem Ester-Strukturtyp der Tabelle 1 von D8.

Im biologischen Beispiel 3.5 von D8 wird die Wirkung dieser drei Verbindungen gegen Botrytis beschrieben. Aufgrund der dargelegten strukturellen Unterschiede hatte nach unserer Auffassung der Fachmann jedoch keinerlei Veranlassung, die beanspruchten Verbindungen herzustellen und gegen Botrytis einzusetzen.

Dokument D16 (FR-A 1 546 183): Die beanspruchten Verbindungen stellen gegenüber den Verbindungen von D16 eine neue Lehre dar, indem der Substituent, welcher in ortho-Position des Anilid-Phenylrings steht, mindestens 3 C-Atome aufweist. Die Neuheit der Verwendungsansprüche liegt in der Bekämpfung von Botrytis.

Was die erfinderischen Tätigkeit angeht, so wird auf die bei der Erörterung des Dokuments D15 angeführten Vergleichsversuche verwiesen.

Dokument D15 (C.A. 81, 115 750): Eine Kopie des Originalartikels liegt bei (s. Anlage 5).

Die Verbindung 116 in Tabelle 1 auf Seite 276 wurde per Disclaimer von den Ansprüchen 1, 4 und 7 ausgenommen.

Die Verbindung 114 in Tabelle 1 auf Seite 276 wurde per Disclaimer von den Ansprüchen 1, 2 und 5 ausgenommen.

11.13.01.95

83

EP Anmeldung Nr. 92 119 105.2-1211 - O.Z. 0050/42835

- 5 -

Verbindung "114" wird von uns als diejenige angesehen, welche aus allen Dokumenten D8 und D14-D17 den beanspruchten Verbindungen strukturell am nächsten kommt.

Als deutlicher Hinweis auf das Vorliegen einer erfinderischen Tätigkeit für die beanspruchten Verbindungen des A2-Typs (Thiazol-5-yl-Derivate) sind die Ergebnisse von biologischen Vergleichsversuchen zu werten, deren Ergebnisse beigelegt sind. Es hat sich gezeigt, daß ihre Botrytis-Wirksamkeit gegenüber der Vergleichsverbindung "114" aus D15 deutlich besser ist, als der Fachmann in Kenntnis des Standes der Technik erwarten konnte (Anlage 6).

#### Gruppe 8 (Pyrazol-4-yl-Derivate; Dokumente D18, D19)

##### Neuheit

Zur neuheitlichen Abgrenzung gegen D19 (WO-A 93/11117; Punkt 8 des Bescheids) wurden per Disclaimer jene Verbindungen I von den Ansprüchen 1, 2 und 5 ausgenommen, in denen "A" für A4' und "R" für gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Cycloalkyloxy oder Cycloalkenyloxy steht.

Die Neuheit der Ansprüche 1, 5 und 7 gegenüber D18 (FR-A 2 337 997) wurde durch Disclaimer in den Ansprüchen 1, 2, 5 und 7 hergestellt. Dagegen wurde in den Ansprüchen 2 und 4 "Methyl" aus der Bedeutung des Substituenten R<sup>5</sup> (neue Bezeichnung) gestrichen.

##### Erfinderische Tätigkeit (gegenüber D18)

Verbindung Nr. 12 in Tabelle I auf Seite 4 von D18 kommt den beanspruchten Verbindungen des Typs A4 (Pyrazole) strukturell am nächsten. Im Vergleich zu diesen zeigte diese bekannte Verbindung aber eine erheblich schwächer Wirkung gegen den Pilz Botrytis. Die Durchführung der Versuche und deren Ergebnisse sind der Anlage 4 zu entnehmen.

Die Prüfungsabteilung wendet unter Punkt 9, Absatz 3, des Bescheids ein, die Verwendung einer als fungizid wirksam bekannten Verbindung gegen den Schadpilz Botrytis stelle keinen neuen Zweck dar und die Verwendungsansprüche, welche diese bekannten Verbindungen umfaßten, seien daher nicht neu. Weiterhin wird auf die

N 13.01.85

84

EP Anmeldung Nr. 92 119 105.2-1211 - O.Z. 0050/42835

- 6 -

Entscheidungen G 2/88 und G 6/88 verwiesen.

Der Entscheidung G 6/88, deren Leitsatz wörtlich mit dem dritten Leitsatz der G 2/88 übereinstimmt, lag folgende Frage zugrunde (vgl. Amtsblatt des EPA 4/1990, Seite 114 ff.):

"Ist ein Anspruch auf die Verwendung einer chemischen Verbindung oder Verbindungsklasse für einen bestimmten nichtmedizinischen Zweck neu im Sinne von Artikel 54 EPÜ gegenüber einem Stand der Technik, der die Verwendung dieser Verbindung(sklasse) für einen anderen nichtmedizinischen Zweck offenbart, wenn die technische Realisierung beider Lehren identisch und das einzige neue Merkmal des Anspruchs der Verwendungszweck selbst ist?"

Die Große Beschwerdekammer kam zu der Entscheidungsformel: "Ein Anspruch, der auf die Verwendung eines bekannten Stoffes für einen bestimmten Zweck gerichtet ist, der auf einer in dem Patent beschriebenen technischen Wirkung beruht, ist dahingehend auszulegen, daß er diese technische Wirkung als funktionelles Merkmal enthält; ein solcher Anspruch ist nach Artikel 54(1) EPÜ dann nicht zu beanstanden, wenn dieses technische Merkmal nicht bereits früher der Öffentlichkeit zugänglich gemacht worden ist."

Diese Überlegungen haben auch Eingang in die "Richtlinien für die Prüfung im Europäischen Patentamt" gefunden (vgl. dort, Teil C, Kapitel IV, Abschnitt 7.6).

In der Sache T 231/85, zitiert in der Entscheidung G 6/88 (s.d., Punkt 7.1, Seite 121), gehörte die Verwendung bestimmter Verbindungen zur Regulierung des Pflanzenwachstums zum Stand der Technik. Die Kammer vertrat die Auffassung, daß der Verwendung eben dieser Verbindungen in einer anderen Indikation, nämlich der Bekämpfung von Pilzen, die Neuheit zukomme, weil "sich die technische Lehre in der Anmeldung von der in der Entgegnhaltung (...) unterscheide, und daß die Verwendung [erg.: zur Bekämpfung von Pilzen] bisher unbekannt gewesen sei, auch wenn das Ausföhrungsmittel dasselbe sei."

Diese Betrachtungsweise läßt sich auf die vorliegende Fragestellung zwanglos übertragen: Der Verwendungszweck der Verbindungen

M 13.01.95

85-

EP Anmeldung Nr. 92 119 105.2-1211 - O.Z. 0050/42835

- 7 -

gemäß den Verwendungsansprüchen liegt in der Bekämpfung von Botrytis. Dieses funktionelle Merkmal ist in den Ansprüchen enthalten. Einige der beanspruchten Verbindungen waren zwar früher bereits als fungizid wirksam bekannt, jedoch war der Öffentlichkeit nicht zugänglich gemacht worden, daß sie sich zur Bekämpfung von Botrytis eignen.

Nach unserer Ansicht kommt daher den vorliegenden Verwendungsansprüchen die Neuheit zu.

BASF Aktiengesellschaft

i.A. *Sorny*

i.A. Werner

AV-Nr. 3224

Anlagen

1. Neue Ansprüche, reinschriftlich, dreifach
2. Neue Ansprüche, handschriftlich korrigiert, einfach
3. Vergleichsversuche gegen D13 (DE-A 24 17 216)
4. Vergleichsversuche gegen D18 (FR-A 2 337 997)
5. Acta Phytopathologica 8, 269-82 (1973) ("D15")
6. Vergleichsversuche gegen die Verbindung "114" aus D15 (= Anlage 5)